



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets

⑪ Veröffentlichungsnummer:

**0071 792**  
**A2**

⑫

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

⑬ Anmeldenummer: 82106335.1

⑮ Int. Cl.: **C 07 D 487/04, A 01 N 43/90**

⑭ Anmelddatum: 15.07.82

//  
(C07D487/04, 239/00, 231/00),  
(C07D487/04, 249/00,  
239/00)

⑯ Priorität: 01.08.81 DE 3130533

⑰ Anmelder: BASF Aktiengesellschaft,  
Carl-Bosch-Straße 38, D-6700 Ludwigshafen (DE)

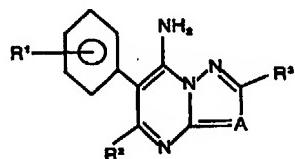
⑲ Veröffentlichungstag der Anmeldung: 16.02.83  
Patentblatt 83/7

⑳ Erfinder: Eicken, Karl, Dr., Waldstrasse 63,  
D-6706 Wachenheim (DE)  
Erfinder: Scheibl, Klaus, Dr., Duerkheimer Strasse 7,  
D-6701 Schauernheim (DE)  
Erfinder: Theobald, Hans, Dr., Parkstrasse 2,  
D-6703 Limburgerhof (DE)  
Erfinder: Pommer, Ernst-Heinrich, Dr., Berliner Platz 7,  
D-6703 Limburgerhof (DE)  
Erfinder: Ammermann, Eberhard, Dr., Sachsenstrasse 3,  
D-6700 Ludwigshafen (DE)

㉑ Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LI LU  
NL SE

㉒ 7-Amino-azolo(1,5-a)pyrimidine und diese enthaltende Fungizide.

㉓ 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formel



worin

R<sup>1</sup> gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxy, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxyl, Arylalkylthio, mit dem Phenylring anneiliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls substituiert sind,

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,

n 1 oder 2,

A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>n</sup>-Gruppe bedeutet, wobei

R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxycarbonyl und zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet und diese enthaltende Fungizide.

**EP 0071 792 A2**

0071792

BASF Aktiengesellschaft

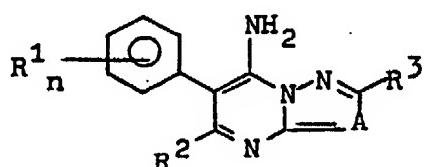
O. Z. 0050/35319

"7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine und diese enthaltende  
Fungizide

5 Die vorliegende Erfindung betrifft neue 7-Amino-azolo-[1,5-a]pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und diese enthaltende Fungizide.

10 Es ist bekannt, daß 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine z.B. das 7-Amino-2-methyl-5-phenyl-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin pharmakologische Eigenschaften besitzen (FR-PS 2 448 542; DD-PS 99 794; DD-PS 55 956; J. pharm. Soc. Japan 84 (1964), S. 1113-1118). Es ist ferner bekannt, N-Trichlor-methylthio-phthalimid als Fungizid zu verwenden (Chemical Week 1972, June 21, Seite 63).

15 20 Es wurde nun gefunden, daß neue 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formel



I

worin

25 R¹ gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indian oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2,

R² und R³ Wasserstoff, Alkyl oder Aryl,

35 Sws/P

- 7 A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeuten,  
 wobei  
 R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen,  
 Cyano, oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine  
 5 Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu zwei Doppel-  
 bindungen bedeutet,  
 eine gute fungizide Wirkung, insbesondere gegen Phycomyceten  
 haben.
- 10 Unter den Resten R<sup>1</sup> sind beispielsweise gegebenenfalls  
 durch Fluor, Chlor, Brom oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxi substituiertes  
 C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkoxi, Cyano,  
 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, Aryl (Phenyl), Aryloxi (Phenyloxi), Aryl-  
 thio (Phenylthio), Arylalkyl (Benzyl), Arylalkyloxi  
 15 (Benzylloxi), Arylalkylthio (Benzylthio) mit 1 bis 6 Kohlen-  
 stoffatomen in den Alkylteilen, mit dem Phenylring annellier-  
 tes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche ge-  
 gebenenfalls im aromatischen Teil durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxi, Cyano, Fluor, Chlor oder Brom substituiert  
 20 sein können, zu verstehen.
- Unter den Resten R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> in der Bedeutung von R<sup>2</sup> ist  
 beispielsweise Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder gegebenenfalls  
 durch Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxi substituiertes  
 25 Phenyl zu verstehen. Darüber hinaus kann R<sup>4</sup> Chlor, Brom,  
 Cyan oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxicarbonyl bedeuten oder zusammen mit  
 R<sup>3</sup> eine gegebenenfalls bis zu zwei Doppelbindungen enthal-  
 tende C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette bedeuten. Unter Alkyl oder Alkyl  
 einer Alkoxygruppe bei den Resten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> ist  
 30 je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome Methyl, Ethyl,  
 Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Nonyl, Decyl,  
 Undecyl oder Dodecyl und ihre Isomeren zu verstehen.
- Es wurde ferner gefunden, daß man 7-Amino-azolo[1,5-a]-  
 35 -pyrimidine der Formel I erhält, indem man substituierte

0071792

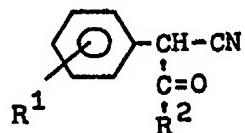
BASF Aktiengesellschaft

- 3 -

O.Z. 0050/35319

\* Benzylcyanide der Formel

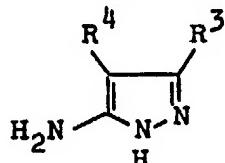
5



II,

in welcher R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit 5(3)-Aminopyrazolen der Formel

10



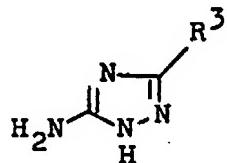
III,

oder mit

15

5(3)-Amino-1,2,4-triazolen der Formel

20



IV,

in welcher R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt.

25

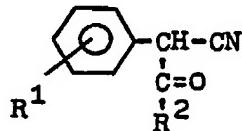
Die Umsetzung kann in Gegenwart oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden. Vorteilhaft ist es, solche Lösungsmittel zu verwenden, gegenüber denen die Einsatzstoffe weitgehend inert sind und in denen sie ganz oder teilweise löslich sind. Als Lösungsmittel kommen insbesondere Alkohole wie Ethanol, Propanole, Butanole, Glycole oder Glykolmonoether, Diethylenglykole oder deren Monoether, Amide wie Dimethylformamid, Diethylformamid, Dibutylformamid, N,N-Dimethylacetamid, niedere Alkansäuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure und Mischungen dieser Lösungsmittel mit Wasser in Frage. Die Umsetzungs-

35

temperaturen liegen zwischen 50 und 300°C, vorzugsweise bei 50 bis 150°C, wenn in Lösung gearbeitet wird.

Die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine werden gegebenenfalls nach Verdampfen des Lösungsmittels oder Verdünnen mit Wasser als kristalline, meist sehr reine Verbindungen isoliert. Bei Verwendung von niederen Alkansäuren als Lösungsmitteln ist es zweckmäßig, gegebenenfalls nach teilweisem Verdampfen der Alkansäure, die Reste der Alkan-  
säure durch Zugabe von wäßrigem Alkali zu neutralisieren, wobei die neuen 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine meist in sehr reiner Form auskristallisieren.

Die für die Herstellung der 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine benötigten substituierten Benzylcyanide der Formel



II,

sind teilweise bekannt oder können nach bekannten Methoden aus Benzylcyaniden und Carbonsäureestern mit Alkalialkoholaten oder Alkalihydriden hergestellt werden (J. Amer. Chem. Soc. 73, (1951) S. 3766).

Allgemeine Herstellungsvorschrift für die substituierten Benzylcyanide der Formel II

1,5 Mol Natriumalkoholat wird in 1 l Toluol eingetragen und anschließend 1,0 Mol eines Benzylcyanids und dann 2,0 Mol eines Carbonsäureesters unter Rühren zugetropft, wobei die Temperatur auf 40 bis 50°C ansteigt. Nach 2-stündigem Nachröhren bei 75 bis 80°C wird abgekühlt und mit 2 l Wasser versetzt. Aus der wäßrigen Phase isoliert man nach zweimaligem Waschen mit 0,2 l Toluol durch Ansäuern

0071792

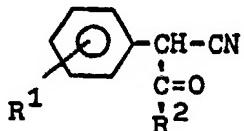
BASF Aktiengesellschaft

- 5 -

O.Z. 0050/35319

"mit halbkonzentrierter (etwa 50 Gew.%) Schwefelsäure auf pH 2 das substituierte Benzylcyanid der Formel II (Ausbeuten: 70 bis 90 %).

5 Auf diese Weise können folgende substituierten Benzylcyanide der Formel



II,

hergestellt werden:

15

20

25

30

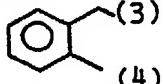
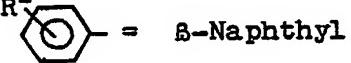
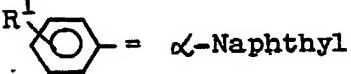
35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 6 -

O.Z. 0050/35319

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Fp. (°C)
<b>5</b>	2-CH <sub>3</sub>	H	89
	3-CH <sub>3</sub>	H	119
	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	169
	3-CH <sub>3</sub> O	H	102
	3-Cl	H	178
	4-Cl	H	164
<b>10</b>	4-Br	H	176
	3-CF <sub>3</sub>	H	107
	3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	82
	3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> O	H	45
	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	90
	4-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub> O	H	116
<b>15</b>	4-IC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	84
		H	205
	(3)		
		H	
	(4)		
	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	170
<b>20</b>	2-CH <sub>3</sub> , 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	120
	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	228
	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> -O	H	188
	4-(ClCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> )	H	81
	2,4-Cl	H	166
	4-CN	H	222
<b>25</b>		H	
	= β-Naphthyl		
		H	
	= α-Naphthyl		
<b>30</b>			

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 7 -

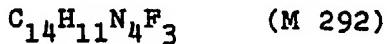
O.Z. 0050/35319

<sup>7</sup> Die folgenden Beispiele betreffen die Herstellung der neuen Wirkstoffe.

Beispiel 1

5

21,3 g m-Trifluormethyl-2-formyl-benzylcyanid und 9,7 g 3(5)-Amino-5(3)-methylpyrazol wurden in 100 ml Eisessig 4 Stunden am Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde der Ansatz mit 500 ml Wasser verdünnt und mit 2 n NaOH-Lösung auf pH 5 bis 6 eingestellt, wobei ein öliges Produkt ausfiel, das nach Anreiben kristallisierte. Nach Absaugen der Kristalle, mehrfachen Waschen mit Wasser und Trocknen im Vakuum bei 50°C erhielt man 25,0 g 7-Amino-2-methyl-6-(3'-trifluormethylphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin vom Fp. 176°C (Verbindung 10).



	C	H	N
ber.: 20	57,54	3,79	19,17
gef.: 15	57,6	3,9	18,9

Beispiel 2

25 10,5 g p-tert.-Butyl-2-formyl-benzylcyanid und 4,8 g 3(5)-Amino-5(3)-methylpyrazol wurden in 40 ml Dimethylformamid 3 Stunden am Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurden 150 ml Wasser zugetropft. Nach dem Absaugen der Kristalle, Waschen mit Wasser und Trocknen im Vakuum bei 30 50°C erhielt man 11,3 g 7-Amino-2-methyl-6-(4'-tert.butyl-phenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin vom Fp. 218°C (Verbindung 5).

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 8 -

O.Z. 0050/35319

 $\text{C}_{17}\text{H}_{20}\text{N}_4$  (M 280)

	C	H	N
ber.:	72,83	7,19	19,98
gef.:	72,8	7,1	19,9

Beispiel 3

11,8 g m-Phenoxy-2-formylbenzylcyanid und 4,3 g 3-Amino-triazol wurden in 40 ml Eisessig 6 Stunden am Rückfluß erhitzt, nach dem Abkühlen mit 300 ml Wasser versetzt und mit 2 n NaOH auf pH 6 eingestellt. Die ausgefallenen Kristalle wurden abgesaugt und getrocknet (14,1 g). Nach Lösen in 30 ml heißem Dimethylformamid abkühlen, Fällen mit 10 ml Methanol, Waschen der abgesaugten Kristalle mit weiterem Methanol und Trocknen erhielt man 9,6 g 7-Amino-6-(3'-phenoxyphenyl)-1,2,4-triazolo[1,5-a]pyrimidin vom Fp. 248-250°C (Verbindung 44).

20  $\text{C}_{17}\text{H}_{13}\text{N}_5\text{O}$  (M 303)

	C	H	N
ber.:	67,32	4,32	23,09
gef.:	67,8	4,2	22,9

25 Nach den oben beschriebenen Verfahren wurden folgende 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine hergestellt.

30

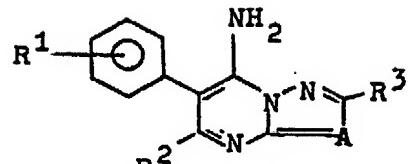
35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 9 -

O.Z. 0050/35319



Nr.	R¹	R²	R³	R⁴	A	Fp. (°C)
1	3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	212
2	3,4(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	188
10	3-CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	224
4	3-CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	158
5	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	218
6	3-CH <sub>3</sub> O	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	124
7	3-Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	174
15	8	4-Cl	H	CH <sub>3</sub>	CR <sup>4</sup>	168
9	4-Br	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	171
10	3-CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	176
11	3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> O	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	173
12	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	150
20	13	4-H <sub>13</sub> C <sub>6</sub> O	H	CH <sub>3</sub>	CR <sup>4</sup>	132
14		H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	328
15	4-IC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	162
16	3,4-Cl <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	160
25	17	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ; 2-CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CR <sup>4</sup>	238
18	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	197
19	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub> O	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	160
20	4-(ClCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	168
21	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	245
30	22	3-CF <sub>3</sub>	H	<u>H</u> —C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CR <sup>4</sup>	184
23	3-CF <sub>3</sub>	H	CH=CH-CH=CH		CR <sup>4</sup>	243
24	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH=CH-CH=CH		CR <sup>4</sup>	248
25	4-CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	200
35	26	3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> O	H	H	CR <sup>4</sup>	166

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 10 -

O.Z. 0050/35319

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	A	Fp. (°C)
5	27 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	H	CR <sup>4</sup>	210
	28 3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CR <sup>4</sup>	273
	29 3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CR <sup>4</sup>	196
	30 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CR <sup>4</sup>	231
	31 4-CN	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	229
	32 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	Br	CR <sup>4</sup>	258
10	R <sup>1</sup> 	= α-Naphthyl	H	CH <sub>3</sub>	CR <sup>4</sup>	242
15	35 	= α-Naphthyl	H	CH <sub>3</sub>	CR <sup>4</sup>	211
	36 2-CH <sub>3</sub>	H	H	-	N	252
	37 3-CH <sub>3</sub>	H	H	-	N	222
	38 3-CH <sub>3</sub> O	H	H	-	N	246
	39 3-CF <sub>3</sub>	H	H	-	N	280
	41 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-	N	327
	42 3-Cl	H	H	-	N	282
	43 4-Br	H	H	-	N	303
	44 3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> O	H	H	-	N	250
	45 4-Cl	H	H	-	N	257
20	46 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	-	N	268
	47 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ; 2-CH <sub>3</sub>	H	H	-	N	288
	48 4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	H	-	N	300
	49 4-H <sub>13</sub> C <sub>6</sub> -O	H	H	-	N	256
	50 4-1-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	-	N	272
	51 3,4-Cl <sub>2</sub>	H	H	-	N	284
	52 2,4-Cl <sub>2</sub>	H	H	-	N	283
	53 4(ClCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> )	H	H	-	N	217
	54 4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> -O	H	H	-	N	268

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	A	Fp. (°C)
5	55 4-CN	H	H	-	N	345
	57 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	N	370
	58 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	242
	59 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	168
	60 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	192
	61 4(4'-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> O)	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	207
10	62 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CN	CR <sup>4</sup>	300
	63 -  =beta-Naphthyl	H	H	-	N	201
15	64 4-cycl.C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	200
	65 4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	CR <sup>4</sup>	260
	66 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	218
	67 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	H	H	-	N	258
	68 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	185
	69 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O	CH <sub>3</sub>	H	-	N	202
20	70 4-nH <sub>13</sub> C <sub>6</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	168
	71 4(CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub> O)	H	H	-	N	235
	72 4(CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub> O)	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	161
	73 4(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -CH-CH <sub>2</sub> O) C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	102
25	74 4(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -CH-CH <sub>2</sub> O) C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	-	N	199
	75 4(n-C <sub>12</sub> H <sub>25</sub> O)	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	98
	76 4(n-C <sub>12</sub> H <sub>25</sub> O)	H	H	-	N	198
	77 4(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O)	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	181
	78 4(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O)	H	H	-	N	235
	79 4(1-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O)	H	CH <sub>3</sub>	H	CR <sup>4</sup>	211
30	80 4(1-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O)	H	H	-	N	270

In entsprechender Weise können die folgenden Verbindungen hergestellt werden:

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	A	Fp. (°C)
33	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -			
40	3-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	-	N	
56	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	-		

5

Die neuen Wirkstoffe zeigen eine starke fungitoxische Wirksamkeit gegen phytopathogene Pilze, insbesondere aus der Klasse der Phycomyceten. Die neuen Verbindungen sind daher beispielsweise geeignet zur Bekämpfung von Phytophthora infestans an Tomaten und Kartoffeln, Phytophthora parasitica an Erdbeeren, Phytophthora cactorum an Äpfeln, Pseudoperonospora cubensis an Gurken, Pseudoperonospora humuli an Hopfen, Peronospora destructor an Zwiebeln, Peronospora sparsa an Rosen, Peronospora tabacina an Tabak, Plasmopara viticola an Reben, Plasmopara halstedii an Sonnenblumen, Sclerospora macrospora an Mais, Bremia lactucae an Salat, Mucor mucedo an Früchten, Rhizopus nigricans an Rüben, Erysiphe graminis an Getreide, Uncinula necator an Reben, Podophyllum leucotricha an Äpfeln, Sphaerotheca fuliginea an Rosen, Erysiphe cichoriacearum an Gurken. Die fungiziden Mittel enthalten 0,1 bis 95 % (Gewichtsprozent) Wirkstoff, vorzugsweise 0,5 bis 90 %. Die Aufwandmengen liegen je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,1 und 5 kg Wirkstoff je ha.

Die neuen Wirkstoffe können auch zusammen mit anderen Wirkstoffen, z.B. Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren und Fungiziden oder auch mit Düngemitteln vermischt und ausgebracht werden. In vielen Fällen erhält man bei der Mischung mit Fungiziden auch eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums; bei einer Anzahl dieser Fungizidmischungen treten auch synergistische Effekte auf, d.h. die fungizide Wirksamkeit des Kombinationsproduktes ist

35

L

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 13 -

O.Z. 0050/35319

größer als die der addierten Wirksamkeiten der Einzelkomponenten. Eine besonders günstige Vergrößerung des Wirkungsspektrums wird mit folgenden Fungiziden erzielt:

- 5 Manganethylenbisdithiocarbamat  
Mangan-Zinkethylenbisdithiocarbamat  
Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat)  
N-Trichlormethylthio-tetrahydropthalimid  
N-Trichlormethyl-phthalimid  
10 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol  
2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol  
2-Rhodanmethylthiobenzthiazol  
1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol  
2,3-Dichlor-6-methyl-1,4-oxathiin-5-carbonsäureanilid  
15 2-Methyl-5,6-dihydro-4-H-pyran-3-carbonsäure-anilid  
2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid  
2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid  
2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid  
N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäure-  
20 -amid  
5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxa-  
zolidin  
3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxa-  
zolidin-2,4-dion.

25

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen kombiniert werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken.

30

Fungizide, die mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen kombiniert werden können sind beispielsweise:

35

Dithiocarbamate und deren Derivate, wie  
Ferridimethyldithiocarbamat

- Zinkdimethyldithiocarbamat  
Zinkethylenbisdithiocarbamat  
Tetramethylthiuramdisulfide  
Zink-(N,N-propylen-bis-dithiocarbamat)
- 5 Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat) und  
N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid
- Nitroderivate, wie
- 10 Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat  
2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat  
2-sec.-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat
- heterocyclische Strukturen, wie
- 15 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat  
2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin  
O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat  
5-Amino-1-(bis-(dimethylamino)-phosphinyl)-3-phenyl-1,2,4-triazol)
- 20 2,3-Dicyano-1,4-dithiaanthrachinon  
2-Thio-1,3-dithio-(4,5-b)-chinoxalin  
1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester  
4-(2-Chlorphenylhydräzono)-3-methyl-5-isoxazolon  
Pyridin-2-thio-1-oxid
- 25 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz  
2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid  
2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin  
2-(Furyl-(2))-benzimidazol
- 30 Piperazin-1,4-di-yl-bis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl))-formamid  
2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol  
5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin  
Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol
- 35 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol

"1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol  
sowie verschiedene Fungizide, wie  
Dodecylguanidinacetat

- 5 3-(3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl)-glutar-imid  
Hexachlorbenzol  
N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid
- 10 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid  
2-Methyl-benzoësäure-anilid  
2-Jod-benzoësäure-anilid  
1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan
- 15 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze  
2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze  
1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-  
-2-butanon
- 20 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-  
-2-butanol  
20  $\alpha$ -(2-Chlorphenyl)- $\alpha$ -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol.

Die neuen Wirkstoffe werden beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentige wässrige, ölige oder sonstige Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten, durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Beizen oder Gießen angewendet. Die Aufwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der neuen Wirkstoffe gewährleisten.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten und Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin

- " oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle usw., sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylool, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate z.B. Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron usw., stark polare Lösungsmittel, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser usw. in Betracht.
- 5      Lösungsmittel gelöst, mittels Haft-, Netz-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden,
- 10     die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind. Als oberflächenaktive Stoffe kommen in Betracht:
- 15     Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäuren, Phenolsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Alkali- und Erdalkalisalze der Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Laurylethersulfat, Fettalkoholsulfate, fettsaure Alkali- und Erdalkalisalze, Salze sulfatiertes Hexadecanole, Heptadecanole, Octadecanole, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfonierte Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Poloxyethylenoctylphenylether, ethoxyliertes Isooctylphenol-, Octylphenol-, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tri-
- 20
- 25
- 30
- 35

5 butylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole,  
Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate,  
ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxy-  
liertes Polyoxypropylen, Laurylakoholpolyglykoletheracetal,  
Sorbitester, Lignin, Sulfitablaugen und Methylcellulose.

10 Pulver, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder  
gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem  
festen Trägerstoff hergestellt werden.

15 10 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homo-  
gengranulaten, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste  
Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind  
z.B. Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kreide,  
Talkum, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium-  
und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe,  
Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat,  
Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie  
Getreidemehle, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehle,  
20 Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Für die folgenden Versuche wurden als bekannte Vergleichswirkstoffe die folgenden Verbindungen verwendet.

25 25 N-Trichlormethylthio-phthalimid (Verbindung A),  
7-Amino-2-methyl-5-phenyl-pyrazolo[1,5-a]-pyrimidin  
(Verbindung B).

30 Versuch 1  
Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

35 35 Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden  
mit wässriger Spritzbrühe, die 80 % (Gew.-%) Wirkstoff und  
20 % Emulgiermittel in der Trockensubstanz enthielt, be-  
sprüht. Um die Wirkungsdauer der Wirkstoffe beurteilen zu

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 18 -

O.Z. 0050/35319

"können, wurden die Pflanzen nach dem Antrocknen des Spritzbelages 10 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung von Plasmopara viticola (Rebenperonospora) infiziert. Danach wurden die Reben zunächst für 16 Stunden in einer wasser-dampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 8 Tage in einem Gewächshaus mit Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in der feuchten Kammer aufgestellt.

5 Dann erfolgte die Beurteilung des Ausmaßes des Pilzausbruches auf den Blattunterseiten. Beispielsweise zeigten die Wirkstoffe 1, 5, 10, 11, 12, 13, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 27, 37, 41, 42, 44 bei Anwendung einer 0,025 %igen Wirkstoffbrühe eine bessere fungizide Wirkung (beispielsweise 100 %ige Wirkung) als die bekannten Vergleichsmittel A und B (beispielsweise 60 %ige Wirkung).

10 15

Beispiele für Zubereitungen sind:

- 20 I. Man vermischt 90 Gew.-Teile der Verbindung 1 mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-alpha-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinstter Tropfen geeignet ist.
- 25 II. 20 Gew.-Teile der Verbindung 5 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gew.-Teilen Xylol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-mono-ethanolamin, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.
- 30 35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 19 -

O.Z. 0050/35319

- III. 20 Gew.-Teile der Verbindung 10 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.
- IV. 20 Gew.-Teile der Verbindung 11 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gew.-Teilen Cyclohexanol, 65 Gew.-Teilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.
- V. 80 Gew.-Teile der Verbindung 37 werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfosäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in der Mischung in Wasser erhält man eine Spritzbrühe.
- VI. 3 Gew.-Teile der Verbindung 41 werden mit 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VII. 30 Gew.-Teile der Verbindung 42 werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprührt wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 20 -

O.Z. 0050/35319

VIII. 40 Gew.-Teile der Verbindung 44 werden mit 10 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates, 2 Teilen Kieselgel und 48 Teilen Wasser innig vermischt. Man erhält eine stabile  
5 wässrige Dispersion. Durch Verdünnen mit Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.

IX. 20 Teile der Verbindung 1 werden mit 2 Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Teilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensats und 68 Teilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölig Dispersion.  
10

15

20

25

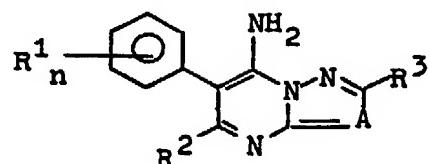
30

35

- Patentansprüche

## 1. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidine der Formel

5



I

10

worin

$R^1$  gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

15

 $n$  1 oder 2

20

$R^2$  und  $R^3$  Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
 $A$  ein Stickstoffatom oder eine  $CR^4$ -Gruppe bedeutet,

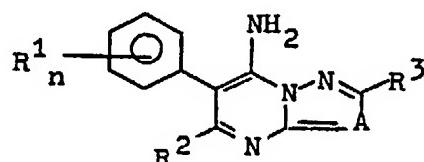
25

$R^4$  wobei die Bedeutung von  $R^2$  hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit  $R^3$  eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

30

## 2. Fungizid enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

35



I

worin

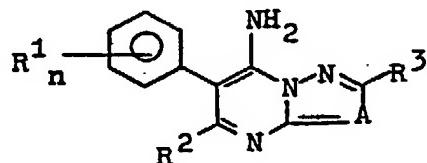
5 R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxy substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxy, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxy, Halogen oder Cyano substituiert sind,

10 n 1 oder 2

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei

15 R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxy carbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

- 20 3. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel



I

worin

30 R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxy substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxy, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 23 -

O.Z. 0050/35319

durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei

R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen,  
Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup>  
eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu  
2 Doppelbindungen bedeutet.

10

4. Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, dadurch gekennzeichnet, daß man einen festen oder flüssigen Trägerstoff vermischt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidin der Formel

20



worin

R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

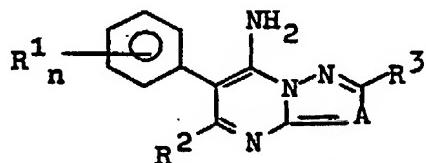
n 1 oder 2

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei

35

<sup>4</sup> R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

5. Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel



I

worin

R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

n 1 oder 2

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei

R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 25 -

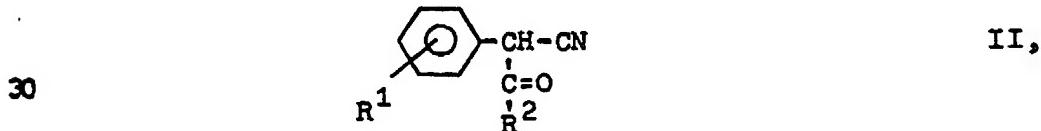
O.Z. 0050/35319

6. Verfahren zur Herstellung eines 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidins der Formel



worin

- 10      R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydro-  
15      naphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,
- n      1 oder 2
- 20      R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A      ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei
- R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu  
25      2 Doppelbindungen bedeutet,  
dadurch gekennzeichnet, daß man ein substituiertes Benzylcyanid der Formel



in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die im Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einem 5(3)-Aminopyrazol der Formel

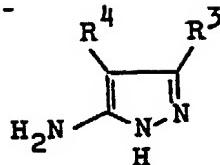
35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 26 -

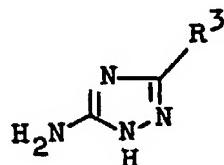
O.Z. 0050/35319



III,

5

oder mit einem 5(3)-Amino-1,2,4-triazol der Formel



IV,

10

in welcher R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die im Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt.

15

7. 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl, R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet.

20

8. Fungizid, enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin, definiert wie in Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl, R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet.

25

30

35

0071792

BASF Aktiengesellschaft

- 27 -

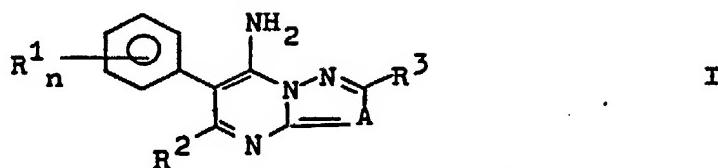
O.Z. 0050/35319

Patentansprüche (für Österreich)

1. Fungizid enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

5

10



worin

15      R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

20      n 1 oder 2

25      R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei  
R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

30

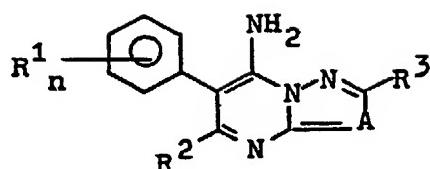
2. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

35

AT

0071792

5



I

worin

10       $R^1$  gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

15

n 1 oder 2

20       $R^2$  und  $R^3$  Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine  $CR^4$ -Gruppe bedeutet,  
wobei

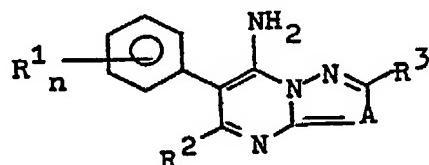
20

$R^4$  die Bedeutung von  $R^2$  hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit  $R^3$  eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

25

3. Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, dadurch gekennzeichnet, daß man einen festen oder flüssigen Trägerstoff vermischt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]-pyrimidin der Formel

30



I

35

worin

5      R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

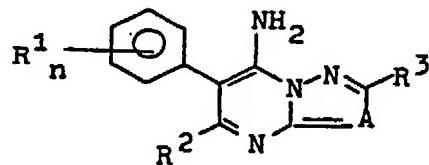
10     n 1 oder 2

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,  
A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet, wobei

15     R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen, Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup> eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu 2 Doppelbindungen bedeutet.

4. 20     Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin der Formel

25



I

worin

30     R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano, Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydronaphthalin,

35

lin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

5 n 1 oder 2

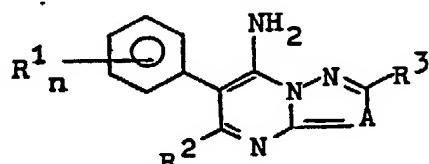
R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei

10 R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen,  
Cyano oder Alkoxycarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup>

15 eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu  
2 Doppelbindungen bedeutet.

5. Verfahren zur Herstellung eines 7-Amino-azolo[1,5-a]-  
15 pyrimidins der Formel



I

worin

20 R<sup>1</sup> gegebenenfalls durch Halogen oder Alkoxi substituiertes Alkyl, Halogen, Alkoxi, Cyano,

25 Cycloalkyl, Aryl, Aryloxi, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxi, Arylalkylthio, mit dem Phenylring annelliertes Benzol, Indan oder Tetrahydro-naphthalin, welche gegebenenfalls im aromatischen Teil durch Alkyl, Alkoxi, Halogen oder Cyano substituiert sind,

30 n 1 oder 2

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff, Alkyl, oder Aryl,

A ein Stickstoffatom oder eine CR<sup>4</sup>-Gruppe bedeutet,  
wobei

35 R<sup>4</sup> die Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und zusätzlich Halogen,

0071792

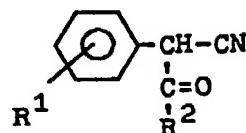
BASF Aktiengesellschaft

- 31 -

O.Z. 0050/35139

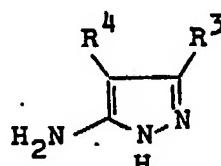
Cyano oder Alkoxicarbonyl oder zusammen mit R<sup>3</sup>  
eine Alkylenkette gegebenenfalls mit bis zu  
2 Doppelbindungen bedeutet,

dadurch gekennzeichnet, daß man ein substituiertes  
5 Benzylcyanid der Formel



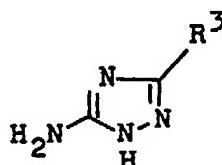
II,

10 in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die im Anspruch 1 genannte Bedeutung  
haben, mit einem 5(3)-Aminopyrazol der Formel



III,

15 oder mit einem 5(3)-Amino-1,2,4-triazol der Formel



IV,

20 25 in welcher R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die im Anspruch 1 angegebenen  
Bedeutungen haben, umgesetzt.

30 6. Fungizid, enthaltend ein 7-Amino-azolo[1,5-a]pyrimidin, definiert wie in Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl, R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeutet.

35

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**